

Виагра®

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, округлые, ромбовидные, с гравировкой "VGR 50" на одной стороне и "Pfizer" на другой.

Владелец регистрационного удостоверения

VIATRIS SPECIALTY (США)

Регистрационный номер

ЛП-(002020)-(РГ-RU)

Латинское название

Viagra®

Действующее вещество

силденафил (sildenafil)

АТХ

G04BE03 Силденафил

Фармакологическая группа

Эректильной дисфункции средство лечения - ФДЭ5 ингибитор

Нозологическая классификация (МКБ-10)

N48.4 Импотенция органического происхождения

Состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, округлые, ромбовидные, с гравировкой "VGR 50" на одной стороне и "Pfizer" на другой.

1 таб.

силденафила цитрат

140.45 мг,

что соответствует содержанию силденафила

100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая (тип 102) - 313.162 мг, кальция гидрофосфат - 104.388 мг, кроскармеллоза натрия - 30 мг, магния стеарат - 12 мг.

Состав пленочной оболочки*: опадрай голубой OY-LS-20921 - 15 мг (содержит гипромеллозу, лактозы моногидрат - 3.675 мг, триацетин, титана диоксид (E171), алюминиевый лак на основе индигокармина (E132)) и опадрай прозрачный YS-2-19114-A - 4.5 мг (содержит гипромеллозу, триацетин).

1 шт. - блистеры (1) - пачки картонные×.1 шт. - блистеры (2) - пачки картонные×.1 шт. - блистеры

(3) - пачки картонные×.2 шт. - блистеры (1) - пачки картонные×.2 шт. - блистеры (2) - пачки

картонные×.2 шт. - блистеры (3) - пачки картонные×.4 шт. - блистеры (1) - пачки картонные×.4 шт. -

блистеры (2) - пачки картонные×.4 шт. - блистеры (3) - пачки картонные×.8 шт. - блистеры (1) -

пачки картонные×.8 шт. - блистеры (2) - пачки картонные×.8 шт. - блистеры (3) - пачки картонные×.12 шт. - блистеры (1) - пачки картонные×.12 шт. - блистеры (2) - пачки картонные×.12 шт. - блистеры (3) - пачки картонные×.

* к пленочному покрытию может быть добавлено до 30 мкг/г ванилина и/или биотина; при этом содержание одного или обоих компонентов в пленочном покрытии составит до 3 мкг для дозировки 100 мг× на лицевую сторону пачки наносится перфорированная строчка контроля первого вскрытия; защитный стикер располагается в левом нижнем углу задней поверхности пачки.

Описание лекарственной формы

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, округлые, ромбовидные, с гравировкой "VGR 50" на одной стороне и "Pfizer" на другой.

Фармакологические свойства

Мощный селективный ингибитор циклогуанозинмонофосфат (цГМФ)-специфической ФДЭ5. Реализация физиологического механизма эрекции связана с высвобождением NO в кавернозном теле во время сексуальной стимуляции. Это, в свою очередь, приводит к увеличению уровня цГМФ, последующему расслаблению гладкомышечной ткани кавернозного тела и увеличению притока крови. Силденафил не оказывает прямого расслабляющего действия на изолированное кавернозное тело человека, но усиливает эффект NO посредством ингибирования ФДЭ5, которая ответственна за распад цГМФ. Силденафил селективен в отношении ФДЭ5 in vitro, его активность в отношении ФДЭ5 превосходит активность в отношении других известных изоферментов фосфодиэстеразы: ФДЭ6 - в 10 раз; ФДЭ1 - более чем в 80 раз; ФДЭ2, ФДЭ4, ФДЭ7-ФДЭ11 - более чем в 700 раз. Силденафил в 4000 раз более селективен в отношении ФДЭ5 по сравнению с ФДЭ3, что имеет важнейшее значение, поскольку ФДЭ3 является одним из ключевых ферментов регуляции сократимости миокарда. Обязательным условием эффективности силденафила является сексуальная стимуляция.

Фармакокинетика силденафила в рекомендуемом диапазоне доз носит линейный характер. После приема внутрь силденафил быстро всасывается. Абсолютная биодоступность в среднем составляет около 40% (от 25% до 63%). In vitro силденафил в концентрации около 1.7 нг/мл (3.5 нМ) подавляет активность ФДЭ5 человека на 50%. После однократного приема силденафила в дозе 100 мг средняя С_{max} свободного силденафила в плазме крови мужчин составляет около 18 нг/мл (38 нМ). С_{max} при приеме силденафила внутрь натощак достигается в среднем в течение 60 мин (от 30 мин до 120 мин). При приеме в сочетании с жирной пищей скорость всасывания снижается: С_{max} уменьшается в среднем на 29%, а Т_{Сmax} увеличивается на 60 мин, однако степень абсорбции достоверно не изменяется (AUC снижается на 11%).

V_d силденафила в равновесном состоянии составляет в среднем 105 л. Связывание силденафила и его основного циркулирующего N-деметильного метаболита с белками плазмы крови составляет около 96% и не зависит от общей концентрации препарата. Менее 0.0002% дозы силденафила (в среднем 188 нг) обнаружено в сперме через 90 мин после приема препарата.

Силденафил метаболизируется, главным образом, в печени под действием изофермента цитохрома CYP3A4 (основной путь) и изофермента цитохрома CYP2C9 (минорный путь). Основным циркулирующим активным метаболитом, образующимся в результате N-деметилирования силденафила, подвергается дальнейшему метаболизму. Селективность действия этого метаболита в отношении ФДЭ сопоставима с таковой силденафила, а его активность в отношении ФДЭ5 in vitro составляет около 50% активности силденафила. Концентрация метаболита в плазме крови здоровых добровольцев составляла около 40% концентрации силденафила. N-деметильный метаболит подвергается дальнейшему метаболизму; T_{1/2} составляет около 4 ч.

Общий клиренс силденафила составляет 41 л/ч, а конечный T_{1/2} - 3-5 ч. После приема внутрь, также как после в/в введения, силденафил выводится в виде метаболитов, в основном, кишечником (около 80% пероральной дозы) и, в меньшей степени, почками (около 13% пероральной дозы).

Показания

Лечение нарушений эрекции, характеризующихся неспособностью к достижению или сохранению эрекции полового члена, достаточной для удовлетворительного полового акта.

Силденафил эффективен только при сексуальной стимуляции.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к силденафилу; применение у пациентов, получающих постоянно или с перерывами донаторы оксида азота, органические нитраты или нитриты в любых формах, поскольку силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов; дети и подростки в возрасте до 18 лет; по зарегистрированному показанию силденафил не предназначен для применения у женщин; не рекомендуется одновременное применение силденафила с ритонавиром, с другими средствами лечения нарушений эрекции. С осторожностью

Анатомическая деформация полового члена (ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони); заболевания, предрасполагающие к развитию приапизма (серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкоз, тромбоцитемия); заболевания, сопровождающиеся кровотечением; обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки; наследственный пигментный ретинит; сердечная недостаточность, нестабильная стенокардия, перенесенные в последние 6 мес инфаркт миокарда, инсульт или жизнеугрожающие аритмии, артериальная гипертензия (АД >170/100 мм рт.ст.) или гипотензия (АД <90/50 мм рт.ст.); у пациентов с эпизодами развития передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва (в анамнезе).

Способ применения и дозы

Принимают внутрь.

Рекомендуемая доза для большинства взрослых пациентов составляет 50 мг примерно за 1 ч до сексуальной активности. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг. Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендуемая кратность применения - 1 раз/сут.

Побочные действия

Со стороны иммунной системы: нечасто - реакции повышенной чувствительности (в т.ч. кожная сыпь), аллергические реакции.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - анемия, лейкопения.

Со стороны обмена веществ и питания: нечасто - ощущение жажды, отеки, подагра, некомпенсированный сахарный диабет, гипергликемия, периферические отеки, гиперурикемия, гипогликемия, гипернатриемия.

Со стороны органа зрения: часто - затуманенное зрение, нарушение зрения, цианопсия; нечасто - боль в глазах, фотофобия, фотопсия, хроматопсия, покраснение глаз/инъекции склер, изменение яркости световосприятия, мидриаз, конъюнктивит, кровоизлияние в ткани глаза, катаракта, нарушение работы слезного аппарата; редко - отек век и прилегающих тканей, ощущение сухости в глазах, наличие радужных кругов в поле зрения вокруг источника света, повышенная утомляемость глаз, видение предметов в желтом цвете (ксантопсия), видение предметов в красном цвете (эритропсия), гиперемия конъюнктивы, раздражение слизистой оболочки глаз, неприятные ощущения в глазах; частота неизвестна - неартериитная передняя ишемическая невропатия зрительного нерва, окклюзия вен сетчатки, дефект полей зрения, диплопия*, временная потеря зрения или снижение остроты зрения, повышение внутриглазного давления, отек сетчатки, заболевания сосудов сетчатки, отслойка стекловидного тела/витреальная тракция.

Со стороны органа слуха: нечасто - внезапное снижение или потеря слуха, шум в ушах, звон в ушах, боль в ушах.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение; нечасто - сонливость, мигрень, атаксия, гипертонус, невралгия, невропатия, парестезия, тремор, вертиго, симптомы депрессии, бессонница, необычные сновидения, повышение рефлексов, гипестезия; редко - судороги, повторные судороги, обморок, нарушение мозгового кровообращения, транзиторная ишемическая атака.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - "приливы"; нечасто - тахикардия, ощущение сердцебиения, снижение или повышение АД, увеличение ЧСС, нестабильная стенокардия, AV-блокада, инфаркт миокарда, тромбоз сосудов головного мозга, остановка сердца, сердечная недостаточность, отклонения в показаниях ЭКГ, кардиомиопатия; редко - фибрилляция предсердий, внезапная сердечная смерть, желудочковая аритмия.

Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа; нечасто - носовое кровотечение, ринит, астма, диспноэ, ларингит, фарингит, синусит, бронхит, увеличение объема отделяемой мокроты, усиление кашля; редко - чувство стеснения в горле, сухость слизистой оболочки полости носа, отек слизистой оболочки полости носа.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, диспепсия; нечасто - гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, рвота, боль в области живота, сухость слизистой оболочки полости рта, глоссит,

гингивит, колит, дисфагия, гастрит, гастроэнтерит, эзофагит, стоматит, отклонение печеночных функциональных тестов от нормы, ректальное кровотечение; редко - гипестезия слизистой оболочки полости рта.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - боль в спине; нечасто - миалгия, боль в конечностях, артрит, артроз, разрыв сухожилия, теносиновит, боль в костях, миастения, синовит.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - цистит, никтурия, недержание мочи, гематурия.

Со стороны половых органов и молочной железы: нечасто - увеличение молочных желез, нарушение эякуляции, отек гениталий, аноргазмия, гематоспермия, повреждение тканей полового члена; редко - длительная эрекция и/или приапизм, кровотечение из полового члена.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь, крапивница, простой герпес, кожный зуд, повышенное потоотделение, изъязвление кожи, контактный дерматит, эксфолиативный дерматит; частота неизвестна - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Прочие: нечасто - ощущение жара, отек лица, реакция фоточувствительности, шок, астения, повышенная утомляемость, боль различной локализации, озноб, случайные падения, боль в области грудной клетки, случайные травмы; редко раздражительность.

Особые указания

Для диагностики нарушений эрекции, определения их возможных причин и выбора адекватного лечения необходимо собрать полный медицинский анамнез и провести тщательное физикальное обследование. Средства лечения эректильной дисфункции следует применять с осторожностью у пациентов с анатомической деформацией полового члена (ангуляция, кавернозный фиброз, болезнь Пейрони), или у пациентов с факторами риска развития приапизма (серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкопения).

Препараты, предназначенные для лечения нарушений эрекции, не следует назначать мужчинам, для которых сексуальная активность нежелательна.

Сексуальная активность представляет определенный риск при наличии заболеваний сердца, поэтому перед началом любой терапии по поводу нарушений эрекции врачу следует направить пациента на обследование состояния сердечно-сосудистой системы. Сексуальная активность нежелательна у пациентов с сердечной недостаточностью, нестабильной стенокардией, перенесенным в последние 6 мес инфарктом миокарда или инсультом, жизнеугрожающими аритмиями, артериальной гипертензией (АД \geq 170/100 мм рт. ст.) или гипотензией (АД \leq 90/50 мм рт. ст.).

В ходе постмаркетингового применения силденафила для лечения эректильной дисфункции сообщалось о таких нежелательных явлениях, как серьезные сердечно-сосудистые осложнения (в т.ч. инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, внезапная сердечная смерть, желудочковая аритмия, геморрагический инсульт, транзиторная ишемическая атака, гипертензия и гипотензия), которые имели временную связь с применением силденафила. Большинство этих пациентов, но не все из них, имели факторы риска сердечно-сосудистых осложнений. Многие из указанных нежелательных явлений наблюдались вскоре после сексуальной активности, и некоторые из них отмечались после приема силденафила без последующей сексуальной активности. Не представляется возможным установить наличие прямой связи между отмечавшимися нежелательными явлениями и указанными или иными факторами.

Силденафил оказывает системное вазодилатирующее действие, приводящее к преходящему снижению АД, что не является клинически значимым явлением и не приводит к каким-либо последствиям у большинства пациентов. Тем не менее, до начала применения силденафила врач должен тщательно оценить риск возможных нежелательных проявлений вазодилатирующего действия у пациентов с соответствующими заболеваниями, особенно на фоне сексуальной активности. Повышенная восприимчивость к вазодилататорам наблюдается у больных с обструкцией выходного тракта левого желудочка (стеноз аорты, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия), а также с редко встречающимся синдромом множественной системной атрофии, проявляющимся тяжелым нарушением регуляции АД со стороны вегетативной нервной системы.

Совместное применение силденафила и альфа-адреноблокаторов может привести к симптоматической артериальной гипотензии у отдельных чувствительных пациентов, силденафил следует с осторожностью применять у пациентов, получающих альфа-адреноблокаторы. Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих альфа-адреноблокаторы, прием силденафила следует начинать только после достижения стабилизации показателей гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы силденафила. Врач должен проинформировать пациентов о том, какие действия следует предпринять в случае появления симптомов постуральной гипотензии.

Были отмечены редкие случаи развития передней неартериитной ишемической невротии зрительного нерва, как причины ухудшения или потери зрения на фоне применения всех ингибиторов ФДЭ5, включая силденафил. Большинство этих пациентов имели факторы риска, такие как экскавация (углубление) диска зрительного нерва, возраст старше 50 лет, сахарный диабет, артериальная гипертензия, ИБС,

гиперлипидемия и курение. Причинно-следственной связи между приемом ингибиторов ФДЭ5 и развитием передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва не выявлено. Врач должен информировать пациента о повышении риска развития передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва, если это состояние у него уже отмечалось. В случае внезапной потери зрения пациентам следует немедленно оказать необходимую медицинскую помощь. У небольшого числа пациентов с наследственным пигментным ретинитом имеются генетически детерминированные нарушения функций ФДЭ сетчатки глаза. Сведения о безопасности применения силденафила у пациентов с пигментным ретинитом отсутствуют, поэтому силденафил следует применять с осторожностью.

В случае внезапного ухудшения слуха или потери слуха на фоне приема силденафила следует немедленно проконсультироваться с врачом.

Силденафил усиливает антиагрегантный эффект нитропруссид натрия, донатора оксида азота, на тромбоциты человека *in vitro*. Данные о безопасности применения силденафила у пациентов со склонностью к кровоточивости или обострением язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки отсутствуют, поэтому силденафил у этих пациентов следует применять с осторожностью. Частота носовых кровотечений у пациентов с ЛГ, связанной с диффузными заболеваниями соединительной ткани, была выше, чем у пациентов с первичной легочной гипертензией (силденафил 3%, плацебо 2.4%). У пациентов, получавших силденафил в сочетании с антагонистом витамина К, частота носовых кровотечений была выше (8.8%), чем у пациентов, не принимавших антагонист витамина К (1.7%).

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

Поскольку при приеме силденафила возможно снижение АД, развитие хроматопсии, затуманенного зрения и других побочных явлений, следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.

Форма выпуска

таб., покр. пленочной оболочкой, 100 мг: 1, 2, 3, 4, 6, 8, 12, 16, 24 или 36 шт.

Производитель

FAREVA AMBOISE (Франция)

Условия выпуска из аптек

Отпускается по рецепту.